

①9 RÉPUBLIQUE FRANÇAISE  
INSTITUT NATIONAL  
DE LA PROPRIÉTÉ INDUSTRIELLE  
PARIS

①1 N° de publication :  
(à n'utiliser que pour les  
commandes de reproduction)

2 685 867

②1 N° d'enregistrement national : 92 00062

⑤1 Int Cl<sup>5</sup> : A 61 K 7/06, 7/075

⑫

DEMANDE DE BREVET D'INVENTION

A1

②2 Date de dépôt : 07.01.92.

③0 Priorité :

⑦1 Demandeur(s) : THOREL Jean Noël — FR.

⑦2 Inventeur(s) : THOREL Jean Noël.

④3 Date de la mise à disposition du public de la  
demande : 09.07.93 Bulletin 93/27.

⑤6 Liste des documents cités dans le rapport de  
recherche : *Se reporter à la fin du présent fascicule.*

⑥0 Références à d'autres documents nationaux  
apparentés :

⑦3 Titulaire(s) :

⑦4 Mandataire : Cabinet Bruder.

⑤4 Compositions contre la desquamation de l'épiderme et du cuir chevelu.

⑤7 Composition contre la desquamation et les pellicules  
caractérisée par le fait qu'elle comprend les composants  
suivants physiologiquement acceptables:

- au moins une hydroxy-1, pyridone-2 sous forme pure  
ou saline, présentant en position 4 un radical alkyle de 1 à  
4C, ou phényle, et, en position 6 un radical alkyle de 1 à  
17C, alkényle de 2 à 17C, ou cycloalkyle de 5 à 10C,
- au moins un dérivé de l'acide undécylénique,
- au moins un conservateur éventuel.

FR 2 685 867 - A1



COMPOSITIONS CONTRE LA DESQUAMATION DE L'EPIDERME ET DU CUIR  
5 CHEVELU.

La présente invention a pour objet de nouvelles  
compositions contre la desquamation de l'épiderme et du cuir  
chevelu qui se traduit habituellement par diverses formes  
telles que l'exfoliation ou les pellicules, lesdites nouvelles  
10 compositions pouvant se présenter notamment sous forme de  
crème, de mousse, de shampoing ou de lotion.

Le problème de l'exfoliation de l'épiderme sous forme de  
desquamation, et du cuir chevelu sous forme de pellicules est  
bien connu et de très nombreuses solutions ont été proposées  
15 par l'art antérieur qui ne donnent pas pleinement satisfaction  
du fait, soit de leur manque d'efficacité, soit de leur prix  
trop élevé, soit de leurs effets secondaires, soit même de leur  
toxicité.

L'idéal serait de parvenir à un rapport qualité/prix, et à  
20 un rapport efficacité/(toxicité + effets secondaires) optimaux.  
C'est le but que s'est fixé le déposant de la présente demande.

On peut résumer comme suit les fonctions, qu'en  
conséquence, doivent remplir les compositions conformes à la  
présente invention:

- 25
- empêcher la prolifération bactérienne et en particulier celle du pytirosporum ovale,
  - diminuer l'épaisseur de la couche de kératine et éviter la desquamation et les pellicules,
  - éviter le prurit.

Ces divers points représentent l'essentiel des problèmes liés à la desquamation et aux pellicules, et l'expérience a montré que le fait de leur apporter une solution permet de mettre un terme aux principales causes et aux principaux effets des phénomènes d'exfoliations.

La présente invention a pour objet, dans le but d'apporter de telles solutions, de nouvelles compositions dans lesquelles sont associés les composants suivants physiologiquement acceptables:

- 10 - au moins une hydroxy-1, pyridone-2 sous forme pure ou saline, présentant en position 4 un radical alkyle de 1 à 4C, ou phényle, et, en position 6 un radical alkyle de 1 à 17C, alkényle de 2 à 17C, ou cycloalkyle de 5 à 10C; selon un mode de réalisation préféré de l'invention, elle peut
- 15 se présenter sous la forme du sel d'éthanolamine de l'hydroxy-1, méthyl-4, (triméthyl-2, 4, 4, pentyl)-6(1H)-pyridone-2;
- au moins un dérivé de l'acide undécylénique, et en particulier un de ses esters avec un sucre du type
- 20 glycérol ou sorbitol, ou les produits résultant de l'acylation par cet acide, d'acides aminés tels ceux issus de l'hydrolyse acide totale du collagène;
- de préférence, au moins un conservateur tel que le phénoxyéthanol.

25 Comme on le verra par la suite, il s'avère que les associations conformes à la présente invention et en particulier l'association des deux familles de produits citées ci-dessus en tête, entraîne un effet de synergie imprévisible quand on compare les effets obtenus à ceux des composants pris

séparément.

L'utilisation complémentaire du conservateur augmente encore ces effets tout en les maintenant, bien entendu, plus longtemps stables.

- 5 Pour mieux faire comprendre les caractéristiques techniques et les avantages de la présente invention, on va en décrire des exemples de réalisations, étant bien entendu que ceux-ci ne sont pas limitatifs quant à leur mode de mise en oeuvre et aux applications qu'on peut en faire.

10 EXEMPLE 1: CREME ANTI-PYROSPORUM OVALE ET ANTI-SQUAMES

Cette crème peut être appliquée telle quelle ou sous forme de mousse sur l'épiderme et en particulier sur la peau et le cuir chevelu notamment dans les cas particulièrement aigus de pellicules ou de dermites séborrhéïques surinfectées par le

15 pytosporum.

On se base sur la composition pondérale suivante :

Phase A	concentrations	préférence
undécylénate de sorbitan	0,3% à 2,0%	1,0%
huile de coprah	2,0% à 10,0%	5,0%
20 triglycérides d'acides gras saturés et fractionnés de coco (C8 à C10)	0,5% à 5,0%	1,0%
sel d'éthanolamine de 1'hydroxy-1, méthyl-4, (triméthyl-2, 4, 4, pentyl)		
25 -6(1H)-pyridone-2;	0,1% à 0,4%	0,2%
alcool C16		0,5%
diméthicone copolyol	0,3% à 2,0%	1,0%

## Phase B

	eau déminéralisée		86,2%
	polyacrylique	0,1% à 0,5%	0,3%
5	polyglycane	0,1% à 0,5%	0,3%

## Phase C

	Eau déminéralisée		1,0%
10	triéthanolamine à 99%	0,1% à 0,3%	0,2%

## Phase D

	phénoxyéthanol	0,2% à 1,0%	0,3%
--	----------------	-------------	------

## Phase E

15	acide 18-bétaglycyrrhétinique	0,1% à 2,0%	1,0%
	propylène glycol		2,0%.

On réalise la phase E par mélange sous agitation. Par ailleurs, dans le tiers de l'eau de la phase B chauffée à 75°C, on incorpore le polyacrylique, puis on homogénéise.

A part également, dans un tiers de l'eau de la phase B chauffée à 75°C, on incorpore le polyglycane et on homogénéise.

Enfin dans le troisième tiers de l'eau de la phase B portée à 75°C sous agitation réduite, on incorpore progressivement les deux premiers tiers d'eau et leurs contenus et on émulsionne l'ensemble.

On réalise la phase A à 75°C sous agitation en saupoudrant le sel d'éthanolamine jusqu'à dissolution totale; on incorpore alors dans l'émulsion obtenue ci-dessus cette phase A sous

agitation modérée puis on incorpore la phase E. On émulsionne le tout et on laisse refroidir jusque vers 38°C toujours sous agitation modérée. On incorpore alors les constituants de la phase D en homogénéisant à grande vitesse, puis la phase C jusqu'à homogénéisation pour neutralisation, on laisse ensuite refroidir à 30°C pour le prélèvement d'un échantillon pour analyse et soutirage subséquent.

On obtient ainsi une crème qui est susceptible d'être utilisée telle quelle comme cela a été dit ci-dessus ou sous forme de mousse que l'on constitue par tous les moyens classiques notamment à l'aide de bombes aérosols.

#### EXEMPLE 2: SHAMPOING ANTIPELLICULAIRE

On se base sur la composition pondérale suivante :

15

Phase A	concentrations	préférences
lauryléthersulfate de sodium		5,0%
amidopropylbétaine de coco		18,8%
oxyde d'amine		4,0%
20 éther polymyristylglycolique		
d'acides gras du suif	0,5% à 3,0%	2,0%
sel d'éthanolamine de 1'hydroxy-1, méthyl-4, (triméthyl-2, 4, 4, pentyl)		
25 -6(1H)-pyridone-2;	0,5% à 1,5%	1,0%
acide undécylénoyl-		
collagénique	0,2% à 2,0%	0,5%

## Phase B

	eau déminéralisée	61,7%
	extrait d'oléorésine végétale	
5	de saule	0,05% à 0,2% 0,1%

## Phase C

	phénoxyéthanol	0,4%
--	----------------	------

## 10 Phase D

	ester de sorbitan éthoxylé	0,1%
--	----------------------------	------

## Phase E

	acide citrique en poudre cristallisé	0,4%
15	eau déminéralisée	5,0%
	diméthicone copolyol	1,0%

On prépare la phase B à 50°C sous agitation réduite.

Par ailleurs on fait fondre à 80°C sous agitation l'oxyde  
20 d'amine et on saupoudre le Talloweth 60 myristylglycol jusqu'à  
dissolution, puis on refroidit jusque vers 70°C avant  
d'incorporer les autres composants de la phase A dans la phase  
B toujours maintenue à 50°C. On homogénéise le tout et on  
laisse refroidir jusque vers 45°C, toujours sous agitation  
25 modérée, pour incorporer successivement les composants des  
phases C,D et E. Sous agitation modérée, on continue  
l'homogénéisation, puis on laisse refroidir lentement jusque  
vers 30°C. On prélève alors un échantillon pour le contrôle et,  
si les résultats sont corrects on peut passer au soutirage.

## EXEMPLE 3: LOTION ANTIPELLELICULAIRE

On se base sur la composition pondérale suivante :

	Phase A	concentrations	préférences
5	undécylénate de sorbitan	0,5% à 1,5%	1,0%
	pyroctone olamine	0,1% à 0,8%	0,4%
	Phase B		
	eau déminéralisée		84,95%
10	polyacrylique		0,3%
	Phase C		
	acide 18 bêta		
	glycyrrhétinique	0,2% à 2,0%	1,0%
15	propylène-glycol		2,0%
	Phase D		
	phénoxyéthanol	0,1% à 0,5%	0,3%
	glycéride d'acide caprique et		
20	d'acide caprylique	5,0% à 12,0%	10,0%
	triéthanolamine à 99%		0,05%

On procède comme suit:

On prépare la phase B en dispersant le polyacrylique sous forte  
 25 agitation dans l'eau; on prépare la phase C sous agitation  
 modérée; on mélange les composants de la phase A en la portant  
 progressivement à 75°C et on l'introduit sous agitation dans la  
 phase B; on ajoute la phase C en refroidissant jusqu'à 40°C  
 puis on incorpore les composants de la phase D en continuant le



refroidissement jusqu'à 30°C.

On notera que dans les trois exemples ci-dessus, on a donné, d'une part des gammes de concentrations dans les cas de certains composants, et, d'autre part, les concentrations  
5 préférées, conformément à l'invention pour tous les composants. Sur les compositions des trois exemples, on a mené les expérimentations suivantes qui illustrent bien les propriétés remarquables des produits de l'invention, surtout quand on les compare avec les propriétés des produits de l'art antérieur.

10

#### EXPERIMENTATIONS IN-VITRO

Il s'agit d'effectuer les comparaisons qui viennent d'être mentionnées, à savoir celles des effets desdites compositions conformes à l'invention, c'est-à-dire contenant l'ensemble des  
15 actifs y compris le sel d'hydroxy-1,pyridone-2 avec les effets de ce qu'on appellera "bases", c'est-à-dire l'ensemble des composants non-considérés comme de véritables actifs, mais destinés à constituer la structure physique de support des  
20 compositions, ainsi qu'avec ces mêmes bases additionnées dudit sel.

Le protocole suivi est classique: on travaille en boîtes de Pietri de préférence de 90mm; on ensemence la gélose avec des suspensions des divers germes; on aspire l'excès de suspension;  
25 on imbibe des disques de papier filtre stériles de 13mm de diamètre avec les produits à expérimenter, ou on dépose ces derniers dans des puits découpés à l'emporte-pièce dans la gélose et on laisse incuber à 37°C pendant 24h pour les bactéries, ou à température ambiante pendant 48h pour les

levures et champignons; on travaille de préférence à raison de quatre disques ou puits par boîte de Pietri; on mesure enfin la largaur moyenne des zones d'inhibition entourant les disques ou puits. On peut résumer les résultats comme suit, les largeurs

5 étant données en millimètres. Pour chaque exemple, la première colonne B donne le résultat pour la base seule, la seconde BS pour la base et le sel , la troisième BSC pour la base, le sel et la composition conforme à l'invention.

10	microorganismes	EXEMPLE 1			EXEMPLE 2			EXEMPLE 3		
		B	BS	BSC	B	BS	BSC	B	BS	BSC
	Pitirosporum ovale	2	5	9	5	2	24	0	6	16
	Candida albicans	4	6	10	5	23	26	0	12	18
	Aspergillus niger				4	22	24	0	8	15
15	Pseudomonas aeruginosa				8	17	18	0	5	9
	Candida guillermoidis				6	23	27			

Les résultats sont particulièrement significatifs puisque l'ajout des composants conformes à l'invention (colonnes BSC)

20 présente des largeurs de zones d'inhibitions supérieures à celles obtenues avec les bases (B) et même avec les bases contenant le sel (S) en lui-même connu de l'art antérieur.

#### EXPERIMENTATIONS IN-VIVO

25

Les expériences ont été menées pour chaque composition des trois exemples sur huit sujets du sexe masculin et quatre du sexe féminin présentant tous au moins un désordre du type sébhorrée, psoriasis, acné ou alopécie notamment. La gamme

d'âge est de 18 à 65 ans avec une moyenne de 34 ans.

On a pratiqué une application journalière pendant six semaines pour la crème et deux fois par semaine pendant six semaines pour le shampoing et la lotion, et on a noté les résultats de la façon suivante:

En ce qui concerne les pellicules, on prélève les squames dans une zone ciblée du vertex, en y appliquant, après grattage doux à la spatule, un tube de verre de section donnée à joint caoutchouté dans lequel on introduit du sérum tamponné et contenant un tensioactif, ce qui met les squames en suspension et dissocie les cellules; on centrifuge puis on compte les cellules au microscope en cellule de Burkner; ces opérations sont menées sur quatre champs de 16 carrés; pour cette expérimentation, les sujets présentaient un état pelliculaire depuis sept ans en moyenne.

Pour l'érythème et le prurit, on a noté l'intensité de 0 à 3 (0=nulle, 1=légère, 2=Moyenne, 3=forte). En ce qui concerne la crème (exemple 1), elle a été appliquée dans les zones suivantes: sillon nasogénien, sourcils et conduit auditif externe, les sujets choisis présentant des dermites séborrhéïques du visage.

Le tableau suivant donne les moyennes par groupe de 12 sujets, la colonne 0 correspondant à l'état initial, et les colonnes 2, 4 et 6 aux états respectifs après 2, 4 et 6 semaines de traitement:

		EXEMPLE 1				EXEMPLE 2				EXEMPLE 3				
semaine		0	2	4	6	0	2	4	6	0	2	4	6	
pellic.						26			10	25				12
5	érythème	1,9	0,4	0,2	0	1,3	0,3	0	0	1,8	1,0	0,7	0	
	prurit	2,2	0,6	0,3	0,1	1,6	0,8	0,4	0,3	1,9	1,2	1,1	0,1	

Encore ici, les résultats sont probants.

## REVENDICATIONS

1- Composition contre la desquamation et les pellicules caractérisée par le fait qu'elle comprend les composants suivants physiologiquement acceptables:

- 5        -    au moins une hydroxy-1, pyridone-2 sous forme pure ou saline, présentant en position 4 un radical alkyle de 1 à 4C, ou phényle, et, en position 6 un radical alkyle de 1 à 17C, alkényle de 2 à 17C, ou cycloalkyle de 5 à 10C,
- au moins un dérivé de l'acide undécylénique.

10    2- Compositions selon la revendication 1 caractérisée par le fait qu'une hydroxy-1,pyridone-2 se présente sous la forme du sel d'éthanolamine de l'hydroxy-1, méthyl-4, (triméthyl-2, 4, 4, pentyl)-6(1H)-pyridone-2.

         3- Composition selon l'une des revendications 1 ou 2 caractérisée par le fait qu'un dérivé de l'acide undécylénique  
15    est l'un de ses esters avec un sucre du type glycérol ou sorbitol.

         4- Composition selon l'une des revendications 1 à 3 caractérisé par le fait qu'un dérivé de l'acide undécylénique est un  
20    produit résultant de l'acylation, par cet acide, d'acides aminés.

         5- Composition selon la revendication 4 caractérisée par le fait qu'un produit résultant de l'acylation est issu de l'hydrolyse acide totale du collagène.

25    6- Composition selon l'une des revendications 1 à 5 caractérisée par le fait qu'elle comprend au moins un conservateur.

         7- Composition selon la revendication 6 caractérisée par le fait qu'un conservateur est le phénoxyéthanol.

8- Crème caractérisée par le fait qu'elle est constituée par l'une des compositions selon l'une des revendications 1 à 7.

9- Shampoing caractérisé par le fait qu'il est constitué par l'une des compositions selon l'une des revendications 1 à 7.

5 10- Lotion caractérisée par le fait qu'elle est constituée par l'une des compositions selon l'une des revendications 1 à 7.

## Compositions for combatting exfoliation of the epidermis and scalp

Description of FR2685867

### COMPOSITIONS AGAINST The EXFOLIATION OF The SKIN AND LEATHER HAIRY.

The present invention has as an aim of new compositions against the exfoliation of the skin and the scalp which usually results in various forms such as exfoliation or the films, the aforementioned new compositions being able to be presented in particular in the form of cream, of foam, shampoo or lotion.

The problem of the exfoliation of the skin in the form of exfoliation, and the scalp in the form of films is well-known and of very many solutions by former art which were proposed do not give satisfaction of the fact fully, either of their lack of effectiveness, or of their too high price, or their side effects, or even of their toxicity.

The ideal would be to arrive to a qualité/prix report/ratio, and a efficacite/(toxicity report/ratio + side effects) optimal.

It is the goal which the depositor of this request set.

One can summarize the functions as follows, that consequently, must fill the compositions in conformity with the present invention:

- to prevent the bacterial proliferation and in private individual that of the oval pytirosporum,
- to decrease the thickness of the layer of keratin and to avoid exfoliation and the films,
- to avoid the prurit.

These various points represent the main part of the problems involved in exfoliation and the films, and the experiment showed that the fact of bringing a solution to them makes it possible to put a term at the principal causes and the principal effects of the phenomena of exfoliations.

The present invention has as an aim, with an aim of bringing of such solutions, of new compositions in which are associated the physiologically acceptable following components:

- at least a hydroxy-l, pyridone-2 in pure form or saltworks, presenting in position 4 a radical alkyl of 1 to 4C, or phenyl, and, in position 6 a radical alkyl of 1 with 17C, alkényle of 2 with 17C, or cycloalkyle of 5 with 10C; according to a mode of realization preferred of the invention, it can to present itself in the shape of the salt of éthanolamine of the hydroxy-l, methyl-4, (triméthyl-2, 4, 4, pentyl)-6(1H) pyridone-2;
- at least a derivative of the undecylenic acid, and in particular one of its esters with a sugar of the type glycerol or sorbitol, or products resulting from the acylation by this acid, of amino acids such those resulting total acid hydrolysis of collagen;
- preferably, at least a conservative such as the phénoxyéthanol.

As it thereafter will be seen, it proves that associations in conformity with the present invention and in particular the association of the two families of products quoted above at the head, involves an effect of synergy unforeseeable when one compares the effects obtained with those of taken components the separately.

The use complementary to the conservative increases these effects further all while maintaining them longer stable, of course.

For better rendering comprehensible the design features and the advantages of this invention, one will describe examples of achievements of them, being of course that those are not restrictive as for their mode of implementation and the applications which one can make.

#### EXAMPLE 1: Anti-pyrosorum CREME OVAL AND Anti-squames

This cream can be applied just as it is or in the form of foam to the skin and in particular to the skin and the scalp in particular in the particularly acute cases of seborrheic films or dermatites to infected by the pytosporum.

One bases oneself on the following ponderal composition

Phase A concentrations preference

undécylénate of sorbitan 0,3% to 2,0% 1,0%

oil copra 2,0% to 10,0% 5,0%

triglycerides of fatty acids

saturated and split

coconut (C8 à C10) 0,5% to 5,0% 1,0%

salt of éthanolamine of

1 ' hydroxy-1, methyl-4,

(triméthyl-2, 4, 4, pentyl)

6(1H)-pyridone-2; 0,1% to 0,4% 0,2%

alcohol C16 0,5%

diméthicone copolyol 0,3% to 2,0% 1,0%

Phase B

demineralized water 86,2%

polyacrylic 0,1% to 0,5% 0,3%

polyglycane 0,1% to 0,5% 0,3%

Phase C

Demineralized water 1,0%

triethanolamine with 99% 0,1% to 0,3% 0,2%

Phase D

phénoxyéthanol 0,2% to 1,0% 0,3%

Phase E

acid 18-beta-glycyrrhétinique 0,1% to 2,0% 1,0%

propylene glycol 2,0%.

One carries out the phase E by mixture under agitation. In addition, in one the third of the water of the phase B heated à 750C, one incorporates the polyacrylic one, then one homogenizes.

Separately also, in a third of the water of the phase B heated à 750C, one incorporates the polyglycane and one homogenizes.

Finally in the third third of the water of the phase B carried to 750C under reduced agitation, one gradually incorporates the first two thirds of water and their contents and one emulsifies the unit.

One carries out phase A with 750C under agitation by powdering salt with éthanolamine until total dissolution; one incorporates then in the emulsion obtained above this phase A under moderate agitation then one incorporates the phase E One emulsifies the whole and one lets always cool until worms 380C under moderate agitation. One then incorporates the components of the phase D while homogenizing at high speed, then the phase C until homogenisation for neutralization, one then lets cool with 300C for the sampling of a sample for analysis and subsequent racking.

One thus obtains a cream which is likely to be used just as it is like that was known as above or in the form of foam quel' one constitutes by all the traditional means in particular using bombs aerosols.

#### EXAMPLE 2: SHAMPOO ANTIPELLICULAIRE

One bases oneself on the following ponderal composition

Phase A concentrations preferences

sodium 5,0% lauryléthersulfate

coconut 18,8% amidopropylbétaine

oxidize amine 4,0%



ether polymyristylglycolic  
 fatty acids of tallow 0,5% à 3,0% 2,0%  
 salt of éthanamine of  
 1 ' hydroxy-l, methyl-4,  
 (triméthyl-2, 4, 4, pentyl)  
 6(1H)-pyridone-2;; 0,5% à 1,5% 1,0%  
 acideundécylénol-  
 collagenic 0,2% to 2,0% 0,5%

#### Phase B

demineralized water 61,7%  
 vegetable oleoresin extract  
 from saule 0,05% to 0,2% 0,1%

#### Phase C

phénoxyéthanol 0,4%

#### Phase D

ester of sorbitan éthoxylé 0,1%

#### Phase E

acid citric out of powder crystallized 0,4%  
 demineralized water 5,0%  
 diméthicone copolyol 1,0%

One prepares the phase B with 500C under reduced agitation.

In addition one dissolves with 800C under agitation oxide of amine and one powders Talloweth 60 myristylglycol until dissolution, then one cools until worms 700C before incorporating the other components of phase A in the phase B always maintained with 500C. The whole is homogenized and one lets cool until worms 450C, always under moderated agitation, successively to incorporate the components of phases C, D and E Under moderated agitation, one continues the homogenisation, then one lets cool slowly until worms 300C. One then takes a sample for control and, if the results are correct one can pass to racking.

### EXAMPLE 3: LOTION ANTIPELLICULAIRE

One bases oneself on the following ponderal composition

#### Phase A concentrations preferences

undécylénate of sorbitan 0,5% to 1,5% 1,0%  
 pyroctone olamine 0,1% to 0,8% 0,4%

#### Phase B

demineralized water 84,95%  
 polyacrylique 0,3%

#### Phase C

acid 18 beta  
 glycyrrhetic 0,2% to 2,0% 1,0%  
 propylene-glycol 2,0%

#### Phase D

phénoxyéthanol 0,1% to 0,5% 0,3  
 glycéride of capric acid and  
 of caprylic acid 5,0% to 12,0% 10,0%  
 triethanolamine with 99% 0,05%

One proceeds as follows:

One prepares the phase B by dispersing the polyacrylic one under strong agitation in water; one prepares the phase C under moderate agitation; one mixes the components of phase A while carrying it gradually with 750C and one introduces it under agitation into the phase B; one adds the phase C while cooling until 400C then one incorporates the components of the phase D continuously cooling until 300C.

One will note that in the three examples above, one gave, on the one hand ranges of concentrations in the cases of certain components, and, on the other hand, the preferred concentrations, in accordance with the invention for all the components.

On the compositions of the three examples, one carried out the following experiments which illustrate well the remarkable properties of the products of the invention, especially when one compares them with the properties of the products of former art.

EXPERIMENTS In-vitro 1 acts to carry out the comparisons which have been just mentioned, namely those of the effects of the aforesaid compositions in conformity with the invention, i.e. containing the whole of the credits including the salt of hydroxy-1, pyridone-2 with the effects of what one appellera "bases", i.e. the whole of the components not-considered as true credits, but intended to constitute the physical structure of support of the compositions, like with these same added bases of the aforesaid salt.

The followed protocol is traditional: one works out of boxes of Pietri preferably of 90mm; one sows the gélose with suspensions of the various germs; the excess of suspension is aspired; one soaks with the discs of filter paper deads of 13mm of diameter with the products to test, or one deposits the latter in wells cut out with the punch in the gélose and one lets incubate with 37°C during 24h for the bacteria, or at ambient temperature during 48h for yeasts and champignons; one works preferably at a rate of four discs or well per box of Pietri; one measures finally the average largaur zones of inhibition surrounding the discs or well. One can summarize the results as follows, the widths being given in millimètres. Pour each example, the first column B gives the result for the base alone, the second BS for the base and salt, the third BSC for the base, salt and the composition in conformity with the invention.

micro-organisms EXAMPLE 1 EXAMPLE 2 EXAMPLE 3

B BS BSC B BS BSC

Oval Pitirosporium 2 5 9 5 2 24 0 6 16

Candida albicans 4 6 10 5 23 26 0 12 18

Aspergillus Niger 4 22 24 0 8 15

Pseudomonas aeruginosa 8 17 18 0 5 9

Candida guilliermodis 6 23 27

Les résultats sont particulièrement significatifs puisque l'ajout des composants conformes à l'invention (colonnes BSC) présente des largeurs de zones d'inhibitions supérieures à celles obtenues avec les bases (B) et même avec les bases contenant le sel (S) en lui-même connu de l'art antérieur.

#### EXPERIMENTATIONS IN-VIVO

Les expériences ont été menées pour chaque composition des trois exemples sur huit sujets du sexe masculin et quatre du sexe féminin présentant tous au moins un désordre du type séborrhée, psoriasis, acné ou alopecie notamment. La gamme d'âge est de 18 à 65 ans avec une moyenne de 34 ans.

On a pratiqué une application journalière pendant six semaines pour la crème et deux fois par semaine pendant six semaines pour le shampoing et la lotion, et on a noté les résultats de la façon suivante: En ce qui concerne les pellicules, on prélève les squames dans une zone ciblée du vertex, en y appliquant, après grattage doux à la spatule, un tube de verre de section donnée à joint caoutchouté dans lequel on introduit du sérum tamponné et contenant un tensioactif, ce qui met les squames en suspension et dissocie les cellules; on centrifuge puis on copte les cellules au microscope en cellule de Burkner; ces opérations sont menée sur quatre champs de 16 carrés; pour cette expérimentation, les sujets présentaient un état pelliculaire depuis sept ans en moyenne.

Pour l'érythème et le prurit, on a noté l'intensité de 0 à 3 (0= nulle, 1=légère, 2=Moyenne, 3=forte). En ce qui concerne la crème (exemple 1), elle a été appliquée dans les zones suivantes: sillon nasogénien, sourcils et conduit auditif externe, les sujets choisis présentant des dermites séborrhéiques du visage.

Le tableau suivant donne les moyennes par groupe de 12 sujets, la colonne 0 correspondant à l'état initial, et les colonnes 2, 4 et 6 aux états respectifs après 2, 4 et 6 semaines de traitement:

EXEMPLE 1 EXEMPLE 2 EXEMPLE 3 semaine 0 2 4 6 0 2 4 6 0 2 4 6 pellic. 26 10 25 12 érythème 1,9 0,4 0,2 0 1,3 0,3 0 0 1,8 1,0 0,7 0 prurit 2,2 0,6 0,3 0,1 1,6 0,8 0,4 0,3 1,9 1,2 1,1 0,1

Encore ici, les résultats sont probants.

Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide

## Claims

### CLAIMS

- 1 Composition against exfoliation and the films characterized by the fact that it includes/understands the physiologically acceptable following components:
  - at least a hydroxy-l, pyridone-2 in pure form or saltworks, presenting in position 4 a radical alkyl of 1 to 4C, or phenyl, and, in position 6 a radical alkyl of 1 with 17C, alkényle of 2 with 17C, or cycloalkyle of 5 with 10C,
  - at least a derivative of the undecylenic acid.
- 2 Compositions according to claim 1 characterized by the fact that a hydroxy-l, pyridone-2 is presented in the shape of the salt of éthanolamine of the hydroxy-l, methyl-4, (triméthyl-2, 4, 4, pentyl)-6(1H)-pyridone-2.
- 3 Composition according to one of the claims 1 or 2 characterized by the fact that a derivative of the undecylenic acid is one of its esters with a sugar of the glycerol type or sorbitol.
- 4 Composition according to one of claims 1 to 3 characterized by the fact that a derivative of the undecylenic acid is a product resulting from the acylation, by this acid, of amino acids.
- 5 Composition according to claim 4 characterized by the fact that a product resulting from the acylation results from the total acid hydrolysis of collagen.
- 6 Composition according to one of claims 1 to 5 characterized by the fact that it includes/understands with the mopins a conservative.
- 7 Composition according to claim 6 characterized by the fact that a conservative is the phénoxyéthanol.
- 8 Cream characterized by the fact that it is consisted one of the compositions according to one of claims 1 to 7.
- 9 Shampoo characterized by the fact that it is consisted one of the compositions according to one of claims 1 to 7.
- 10 Lotion characterized by the fact that it is consisted one of the compositions according to one of claims 1 to 7.

---

Supplied from the esp@cenet **database** - I2 dated

INSTITUT NATIONAL  
de la  
PROPRIETE INDUSTRIELLERAPPORT DE RECHERCHE  
établi sur la base des dernières revendications  
déposées avant le commencement de la rechercheFR 9200062  
FA 465842

DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS		Revendications concernées de la demande examinée
Catégorie	Citation du document avec indication, en cas de besoin, des parties pertinentes	
X	FR-A-2 191 904 (FARBWERKE HOECHST AG.) * page 9, ligne 14 * * page 5, ligne 38 - ligne 40 * * page 6, ligne 1-6 * * revendications 1-3; exemple 6 * ---	1, 2, 9
Y	EP-A-0 422 508 (KAO CORPORATION) * page 4, ligne 29 - ligne 58 * * page 5, ligne 1 - ligne 15 * * page 6, ligne 19 - ligne 26 * * page 6, ligne 47 - ligne 48 * ---	1-3, 8-10
Y	EP-A-0 028 459 (IMPERIAL CHEMICAL INDUSTRIES LIMITED) * page 1, ligne 19 - ligne 26; revendications 1-4 * ---	1-3, 8-10
A	SEIFEN, ÖLE, FETTE, WACHSE vol. 112, no. 19, 5 Décembre 1986, AUGSBURG pages 667 - 671; W. MOLLS ET AL: 'ANTISCHUPPENMITTEL. WIRKUNG IN KOSMETISCHEN PRÄPARATEN' * le document en entier * -----	1-10
		DOMAINES TECHNIQUES RECHERCHES (Int. Cl.5)
		A61K
Date d'achèvement de la recherche 17 AOÛT 1992		Examineur SIERRA GONZALEZ
<p><b>CATEGORIE DES DOCUMENTS CITES</b></p> <p>X : particulièrement pertinent à lui seul Y : particulièrement pertinent en combinaison avec un autre document de la même catégorie A : pertinent à l'encontre d'au moins une revendication ou arrière-plan technologique général O : divulgation non-écrite P : document intercalaire</p> <p>T : théorie ou principe à la base de l'invention E : document de brevet bénéficiant d'une date antérieure à la date de dépôt et qui n'a été publié qu'à cette date de dépôt ou qu'à une date postérieure. D : cité dans la demande L : cité pour d'autres raisons ..... &amp; : membre de la même famille, document correspondant</p>		